



(12) Translation of
european patent specification

(11) NO/EP 2421869 B1

NORWAY

(19) NO
(51) Int Cl.
C07D 493/20 (2006.01)
A61K 31/357 (2006.01)

A61K 31/437 (2006.01)
A61P 31/00 (2006.01)
C07D 498/22 (2006.01)

Norwegian Industrial Property Office

(21)	Translation Published	2015.07.20
(80)	Date of The European Patent Office Publication of the Granted Patent	2015.03.11
(86)	European Application Nr.	10714069.1
(86)	European Filing Date	2010.03.18
(87)	The European Application's Publication Date	2012.02.29
(30)	Priority	2009.04.20, IT, MI20090653
(84)	Designated Contracting States:	AT BE BG CH CY CZ DE DK EE ES FI FR GB GR HR HU IE IS IT LI LT LU LV MC MK MT NL NO PL PT RO SE SI SK SM TR
	Designated Extension States:	AL BA ME RS
(73)	Proprietor	ALFA WASSERMANN S.p.A., Via Enrico Fermi, 1, 65020 Alanno (PE), IT-Italia
(72)	Inventor	VISCOMI, Giuseppe Claudio, 5 Via Ragazzi Del '99, I-40133 Bologna, IT-Italia CAMPANA, Manuela, 5 Via Ragazzi Del '99, I-40133 Bologna, IT-Italia FOLEGATTI, Mahena, 5 Via Ragazzi Del '99, I-40133 Bologna, IT-Italia CANNATA, Vincenzo, 5 Via Ragazzi Del '99c/o Alfa Wassermann S.p.A.Patents Dept., I-40133 Bologna, IT-Italia RIGHI, Paolo, 5 Via Ragazzi Del '99C/o Alfa Wassermann S.p.A.Patents Dept., I- 40133 Bologna, IT-Italia ROSINI, Goffredo, 5 Via Ragazzi Del '99C/o Alfa Wassermann S.p.A.Patents Dept., I-40133 Bologna, IT-Italia
(74)	Agent or Attorney	Oslo Patentkontor AS, Postboks 7007 Majorstua , 0306 OSLO, Norge

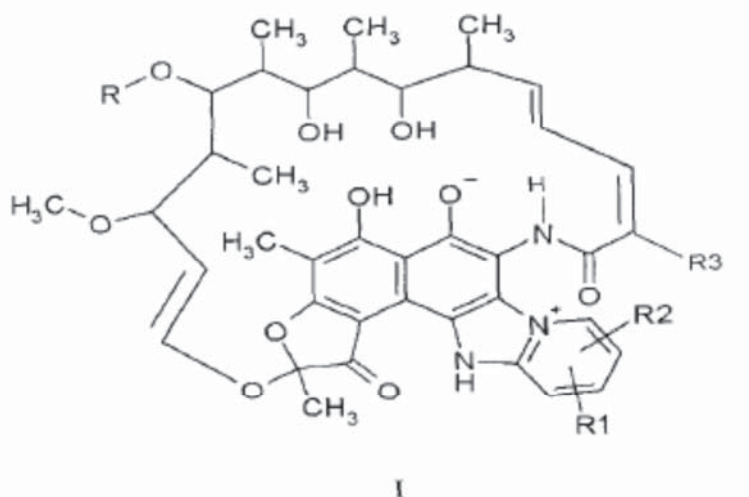
(54)	Title	Rifamycin derivative
(56)	References Cited:	EP-A- 0 161 534 CH-A- 547 854 CH-A5- 571 064 US-A- 4 267 274 MARTINELLI E ET AL: "RIFAMYCIN R A NOVEL METABOLITE FROM A MUTANT OF NOCARDIA-MEDITERRANEA" JOURNAL OF ANTIBIOTICS, JAPAN ANTIBIOTICS RESEARCH ASSOCIATION, TOKYO, JP, vol. 31, no. 10, 1 January 1978 (1978-01-01), pages 949-951, XP009125544 ISSN: 0021-8820 MARCHI E ET AL: "4-deoxypyrido[1',2':1,2]imidazo[5,4-c]rif amycin SV derivatives. A new series of semisynthetic rifamycins with high antibacterial activity and low gastroenteric absorption" JOURNAL OF MEDICINAL CHEMISTRY 1985 US, vol. 28, no. 7, 1985, pages 960-963, XP002554520 ISSN: 0022-2623 CELLAI L ET AL: "STRUCTURE-ACTIVITY RELATIONSHIPS IN 4 DEOXYPYRIDO-1' 2'-1 2- IMIDAZO-5 4-C-RIFAMYCIN SV DERIVATIVES" FARMACO, SOCIETA CHIMICA ITALIANA, PAVIA, IT, vol. 44, no. 2, 1 January 1989 (1989-01-01), pages 97-108, XP009125448 ISSN: 0014-827X

Enclosed is a translation of the patent claims in Norwegian. Please note that as per the Norwegian Patents Acts, section 66i the patent will receive protection in Norway only as far as there is agreement between the translation and the language of the application/patent granted at the EPO. In matters concerning the validity of the patent, language of the application/patent granted at the EPO will be used as the basis for the decision. The patent documents published by the EPO are available through Espacenet (<http://worldwide.espacenet.com>) or via the search engine on our website here: <https://search.patentstyret.no/>

Patentkrav

1. Forbindelse av formel I

5



hvor:

R er acetyl,

10 R₁ er hydrogen,

R₂ er p-metyl og

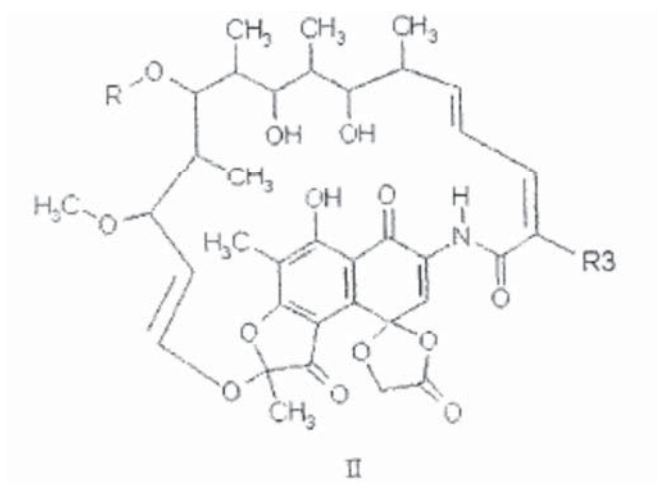
R₃ er hydroksymetyl,

og som er (16Z,18E,28E)-25-(acetyloksy)-5,21,23-trihydroksy-16-(hydroksymetyl)
-27-metoksy-2,4,11,20,22,24-heptametyl-1,15-diokso-1,13-dihydro-2H-2,7-

15 (epoksy-pentadeca[1,11,13]trienoimino)furo[2'',3'':7'8']nafto[1',2':4,5]imidazo[1,2-a]pyridin-8-ium-6-olat.

2. Fremgangsmåte for syntetisering av en forbindelse ifølge krav 1, omfattende å omsette en forbindelse av formel II

20



hvor R er acetyl, og R₃ er hydroksymetyl med 2-amino-4-metyl-pyridin ved nærvær av organiske oppløsningsmidler, en blanding av fler enn et organisk oppløsningsmiddel eller en blanding av et organisk oppløsningsmiddel med vann, ved en temperatur mellom romtemperatur og 60 °C i en tid mellom 1 og 100 timer.

- 5 3. Fremgangsmåte ifølge krav 2, hvor det organiske oppløsningsmiddel er valgt fra gruppen bestående av aromatiske hydrokarboner, alifatisk alkohol, halogenerte hydrokarboner, lavere alkylester av lavere alifatisk syre, glykoler, acetonitril, dioksan, tetrahydrofuran og en kombinasjon derav eller i blanding med vann i forskjellig volumetrisk forhold.
- 10 4. Farmasøytisk sammensetning omfattende en terapeutisk effektiv mengde av en forbindelse av formel I i kombinasjon med et eller flere farmasøytisk akseptable ingredienser.
- 15 5. Farmasøytisk sammensetning ifølge krav 4, eventuelt sammen med et eller flere ytterligere antibiotika for anvendelse i en fremgangsmåte for å behandle, forebygge eller lette bakterieovervekst hos en pasient som lider av en tarmrelatert lidelse.
- 20 6. Farmasøytisk sammensetning for anvendelse ifølge krav 5, hvor den tarmrelaterte lidelsen er en eller flere av irritabelt tarmsyndrom, diaré hos reisende, bakteriell overvekst i tynntarmen, Crohns sykdom, kronisk pankreatitt, pankreatisk insuffisiens, hepatisk encefalopati, divertikulitt eller kolitt.